

日本国特許庁
JAPAN PATENT OFFICE

27.08.03

#2

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出願年月日
Date of Application: 2002年 8月28日

REC'D 17 OCT 2003

出願番号
Application Number: 特願2002-248579
[ST. 10/C]: [JP2002-248579]

WIPO PCT

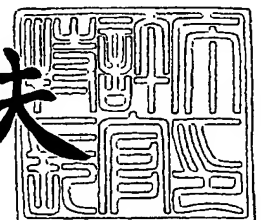
出願人
Applicant(s): サンスター株式会社
日本新薬株式会社

PRIORITY
DOCUMENT
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)

2003年10月 1日

特許庁長官
Commissioner,
Japan Patent Office

今井康夫



BEST AVAILABLE COPY

【書類名】 特許願

【整理番号】 39802JP

【提出日】 平成14年 8月28日

【あて先】 特許庁長官殿

【国際特許分類】 A61K 7/06

【発明者】

【住所又は居所】 大阪府高槻市朝日町 3 - 1 サンスター株式会社内

【氏名】 仲尾次 浩一

【発明者】

【住所又は居所】 大阪府高槻市朝日町 3 - 1 サンスター株式会社内

【氏名】 松浦 昌宏

【発明者】

【住所又は居所】 大阪府高槻市朝日町 3 - 1 サンスター株式会社内

【氏名】 林 直子

【発明者】

【住所又は居所】 京都府京都市南区吉祥院西ノ庄門口町 1 4 番地 日本新薬株式会社内

【氏名】 西 豊行

【特許出願人】

【識別番号】 000106324

【氏名又は名称】 サンスター株式会社

【特許出願人】

【識別番号】 000004156

【氏名又は名称】 日本新薬株式会社

【代理人】

【識別番号】 100065215

【弁理士】

【氏名又は名称】 三枝 英二

【電話番号】 06-6203-0941

【選任した代理人】

【識別番号】 100076510

【弁理士】

【氏名又は名称】 掛樋 悠路

【選任した代理人】

【識別番号】 100086427

【弁理士】

【氏名又は名称】 小原 健志

【選任した代理人】

【識別番号】 100090066

【弁理士】

【氏名又は名称】 中川 博司

【選任した代理人】

【識別番号】 100094101

【弁理士】

【氏名又は名称】 舘 泰光

【選任した代理人】

【識別番号】 100099988

【弁理士】

【氏名又は名称】 斎藤 健治

【選任した代理人】

【識別番号】 100105821

【弁理士】

【氏名又は名称】 藤井 淳

【選任した代理人】

【識別番号】 100099911

【弁理士】

【氏名又は名称】 関 仁士

【選任した代理人】

【識別番号】 100108084

【弁理士】

【氏名又は名称】 中野 睦子

【手数料の表示】

【予納台帳番号】 001616

【納付金額】 21,000円

【提出物件の目録】

【物件名】 明細書 1

【物件名】 要約書 1

【包括委任状番号】 9803926

【プルーフの要否】 要

【書類名】 明細書

【発明の名称】 経口用育毛剤

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 シソ科 (Lamiaceae) オルソシフォン属 (Orthosiphon Benth.) 又はクマツヅラ科 (Verbenaceae) ハマゴウ属 (Vitex L.) に属するいずれかの植物又はその植物抽出物を 1 種又は 2 種以上含有する経口用育毛剤。

【請求項 2】 シソ科オルソシフォン属に属する植物が、ネコノヒゲ (オルソシフォン アリスタツス (ブルメ) ミク (Orthosiphon aristatus (Blume) Miq.))、オルソシフォン グランディフルロス ボルド (Orthosiphon grandiflorus Bold.)、オルソシフォン ルビクンデウス ベント (Orthosiphon rubicundus Benth.)、オルソシフォン スピカツス ベント (Orthosiphon spicatus Benth.) 及びオルソシフォン スタミネウス ベント (Orthosiphon stamineus Benth.) からなる群から選ばれる 1 種又は 2 種以上の植物である、請求項 1 に記載の経口用育毛剤。

【請求項 3】 クマツヅラ科ハマゴウ属に属する植物が、ミツバハマゴウ (Vitex trifolia L.)、ハマゴウ (Vitex rotundifolia L.f.)、ニンジンボク (Vitex cannabifolia Sieb.et Zucc.)、タイワンニンジンボク (Vitex negundo L.) 又はセイヨウニンジンボク (Vitex agnus-castus L.) からなる群から選ばれる 1 種又は 2 種以上の植物である、請求項 1 に記載の経口用育毛剤。

【請求項 4】 経口用育毛剤が育毛用食品である請求項 1 ～ 3 のいずれかに記載の経口用育毛剤。

【発明の詳細な説明】

【0 0 0 1】

【発明の属する技術分野】

本発明は、優れた脱毛防止、発毛効果等の作用を奏する経口用育毛剤に関する。

【0 0 0 2】

【従来の技術】

近年、ストレスの増加や食生活の変化など様々な社会環境の変化によって、薄

毛や抜け毛で悩む男女の数は増加しているといわれており、育毛剤への期待や社会的要求は高まってきている。これまでも、薄毛や抜け毛の原因を取り除く、あるいは、軽減するために、各種薬剤を配合した育毛剤が知られている。例えば、毛根への血流量を改善するためのセンブリエキス、酢酸トコフェロールや頭皮代謝改善のためのヒノキチオールなどが配合され、脱毛症の予防および治療に用いられている。

【0003】

しかし、薄毛や抜け毛の原因は遺伝的素因、ストレス、食生活の変化や老化などの様々な要因が複雑に絡まって生じると考えられており、従来の育毛剤のように、血行促進や頭皮代謝改善のためにセンブリエキス等を配合するだけでは満足のいく脱毛防止や発毛効果は得られない。

【0004】

ネコノヒゲ（オルソシフォン アリスタツス（ブルメ）ミク (Orthosiphon aristatus (Blume) Miq.)）やオルソシフォン スタミネウス ベント (Orthosiphon stamineus Benth.) は、シソ科オルソシフォン属に属する多年草で、インド、東南アジア、オーストラリア北部、我が国においては沖縄に分布している。インド、マレーシア、インドネシア地方では重要な民間薬として用いられており、急性・慢性腎炎、膀胱炎、尿路結石、胆石、リウマチ性関節炎や糖尿病などの症状を軽減するための効果を有することが知られている。

【0005】

特に、インドネシアではクミスクチンと称され、腎炎や尿路結石等によく効く民間薬として飲用されている。シソ科オルソシフォン属植物、若しくは、植物抽出物の頭髮化粧料や育毛剤など頭皮への外用剤としての利用については、特開平10-29924号公報、特開平11-228337号公報、特開2000-95663号、特開2001-224330号で報告されているが、その効果は満足のいくものではなかった。

【0006】

一方、クマツヅラ科ハマゴウ属に属する植物としては、セイヨウニンジンボク (Vitex agnus-castus L.) やミツバハマゴウ (Vitex trifolia L.) などが知ら

れている。

【0007】

セイヨウニンジンボクは、南ヨーロッパからアジア西部に分布している。ヨーロッパでは果実を香料として、葉や果実は薬用として用いられている。薬用としては、利尿薬、感冒薬、男性の性淫薬、更年期の抗うつ症薬として用いられている。セイヨウニンジンボクの植物体、若しくは、植物抽出物の育毛外用剤としての利用については、DE 3442961で報告されているが、その効果は満足のものではなかった。

【0008】

また、ミツバハマゴウは、朝鮮半島から東南アジア、オーストラリアまで広く分布している。中国ではミツバハマゴウの果実をマンケイシと称し、頭痛、感冒、下熱、鎮痛、鎮静、消炎等に用いられている。ミツバハマゴウの植物体、若しくは、植物抽出物の頭髮化粧料や育毛剤など頭皮への外用剤としての利用については、中薬辞典 (pp. 2456-2458)、特開昭59-116211号公報、特開2000-31512号で報告されている。

【0009】

しかし、従来、シソ科オルソシフォン属又はクマツヅラ科ハマゴウ属に属する植物を用いた頭髮化粧料や育毛剤などの外用剤の効果は満足のものではなかった。

【0010】

また、それらの経口用育毛剤としての利用は従来知られていなかった。

【0011】

【発明が解決しようとする課題】

本発明は、優れた育毛作用を有し、脱毛防止、発毛促進などの効果を有意に発揮する経口用育毛剤を提供することを主な目的とする。

【0012】

【課題を解決するための手段】

本発明者らは、上記課題を解決するため鋭意検討を行った結果、シソ科オルソシフォン属又はクマツヅラ科ハマゴウ属に属するいずれかの植物又はその植物抽

出物が、外用剤としての頭皮への適用よりも経口用育毛剤として摂取することにより、優れた育毛作用を有することを見出し、更に検討を重ねて本発明を完成するに至った。

【0013】

即ち、本発明は、以下の事項を包含する。

【0014】

1. シソ科 (Lamiaceae) オルソシフォン属 (Orthosiphon Benth.) 又はクマツヅラ科 (Verbenaceae) ハマゴウ属 (Vitex L.) に属するいずれかの植物又はその植物抽出物を 1 種又は 2 種以上含有する経口用育毛剤。

【0015】

2. シソ科オルソシフォン属に属する植物が、ネコノヒゲ (オルソシフォン アリスタツス (ブルメ) ミク (Orthosiphon aristatus (Blume) Miq.))、オルソシフォン グランディフルロス ボルド (Orthosiphon grandiflorus Bold.)、オルソシフォン ルビクンデウス ベント (Orthosiphon rubicundus Benth.)、オルソシフォン スピカツス ベント (Orthosiphon spicatus Benth.) 及びオルソシフォン スタミネウス ベント (Orthosiphon stamineus Benth.) からなる群から選ばれる 1 種又は 2 種以上の植物である、1 に記載の経口用育毛剤。

【0016】

3. クマツヅラ科ハマゴウ属に属する植物が、ミツバハマゴウ (Vitex trifolia L.)、ハマゴウ (Vitex rotundifolia L.f.)、ニンジンボク (Vitex cannabifolia Sieb.et Zucc.)、タイワンニンジンボク (Vitex negundo L.) 又はセイヨウニンジンボク (Vitex agnus-castus L.) からなる群から選ばれる 1 種又は 2 種以上の植物である、1 に記載の経口用育毛剤。

【0017】

4. 経口用育毛剤が育毛用食品である 1～3 のいずれかに記載の経口用育毛剤。

【0018】

【発明の実施の形態】

シソ科オルソシフォン属に属する植物

本発明に用いられるシソ科オルソシフォン属に属する植物には、例えば、ネコノヒゲ（オルソシフォン アリスタツス（ブルメ）ミク (Orthosiphon aristatus (Blume) Miq.)）、オルソシフォン グランディフルロス ボルド (Orthosiphon grandiflorus Bold.)、オルソシフォン ルビクンデウス ベント (Orthosiphon rubicundus Benth.)、オルソシフォン スピカツス ベント (Orthosiphon spicatus Benth.) 及びオルソシフォン スタミネウス ベント (Orthosiphon stamineus Benth.) などが挙げられる。

【0019】

本発明で用いるシソ科オルソシフォン属植物は、原料植物の生または乾燥品を粉砕したものをそのまま使用してもよいが、上記植物から有効成分を効果的に抽出して得た抽出物を使用してもよい。使用する植物の部分は特に限定されず、茎、葉、花などの地上部、根などの地下部又は全草を使用することが出来るが、特に地上部が好ましい。抽出物は、植物の生または乾燥物を細切した後、適当な溶媒、好ましくは水、低級アルコール、あるいはそれらの混合溶媒で抽出して得ることができる。

【0020】

抽出に用いる低級アルコールとしては、炭素数1～3のアルコール、例えば、メタノールやエタノールなどが挙げられる。このうち、エタノールが最も好ましいが、含水アルコール（含水率0.1～99.9%）でもよい。

【0021】

抽出操作は、バッチ法、パーコレーション法、還流法などの公知の方法で行えばよい。抽出溶媒の比率は特に限定されるものではないが、植物の生または乾燥物（細切したもの）1部に対して抽出溶媒2～1000部が適当である。抽出温度は、室温、加温下、いずれでもよいが、室温～80℃程度の温度範囲で約1～10時間、穏やかな条件で攪拌しながら行うのが好ましい。

【0022】

また、抽出材料を円筒に詰め、溶媒を上から滴加する方法でもよい。

【0023】

クマツヅラ科ハマゴウ属に属する植物

本発明で用いるクマツヅラ科ハマゴウ属に属する植物には、例えば、ミツバハマゴウ (*Vitex trifolia* L.)、ハマゴウ (*Vitex rotundifolia* L.f.)、ニンジンボク (*Vitex cannabifolia* Sieb.et Zucc.)、タイワンニンジンボク (*Vitex negundo* L.)又はセイヨウニンジンボク (*Vitex agnus-castus* L.)などが挙げられる。

【0024】

本発明で用いるクマツヅラ科ハマゴウ属に属する植物は、原料植物の生または乾燥品を粉砕したものをそのまま使用してもよいが、上記植物から有効成分を効果的に抽出して得た抽出物を使用してもよい。使用する植物の部分は特に限定されず、根、幹、枝、葉、花、果実等、いずれを使用してもよい。

【0025】

植物抽出物は植物の生または乾燥物を細切した後、適当な溶媒、好ましくは水、低級アルコール、あるいはそれらの混合溶媒で抽出して得ることができる。

【0026】

抽出に用いる低級アルコールとしては、炭素数1～3のアルコール、例えば、メタノールやエタノールなどが挙げられる。このうち、エタノールが最も好ましい。また、含水アルコール（含水率0.1～99.9%）でもよい。

【0027】

抽出操作は、バッチ法、パーコレーション法、還流法などの公知の方法で行えばよい。抽出溶媒の比率は特に限定されるものではないが、植物の生または乾燥物（細切したもの）1部に対して抽出溶媒2～1000部が適当である。抽出温度は、室温、加温下、いずれでもよいが、室温～80℃程度の温度範囲で約1～10時間、穏やかな条件で攪拌しながら行うのが好ましい。

【0028】

また、抽出材料を円筒に詰め、溶媒を上から滴加する方法でもよい。

【0029】

本発明に用いられるクマツヅラ科ハマゴウ属に属する植物としては、特に、セイヨウニンジンボク、ミツバハマゴウを、好適に用いることができる。

【0030】

製剤

本発明の経口用育毛剤は、健康食品、機能性食品、サプリメントなどに好適な製剤として適用することができる。これらは医薬品として用いても良い。

【0031】

本発明の経口用育毛剤を用いた製剤は、シソ科オルソシフォン属又はクマツヅラ科ハマゴウ属に属するいずれかの植物体若しくはその植物抽出物を、そのまま利用するか、担体として使用することのできる素材と混合し、粉末状、塊状、液状などの各種形態に加工することにより、調製される。

【0032】

シソ科オルソシフォン属又はクマツヅラ科ハマゴウ属に属する植物若しくは植物抽出物は、いずれも人体に対して有毒性を示さないことから、経口用育毛剤への配合量は特に限定はされないが、原料乾物換算として、通常成人1日当たり0.1～100g、好ましくは、1～60gを1～3回に分けて経口摂取できる投与単位とすれば良い。

【0033】

本発明においては、更に、錠剤、散剤、顆粒剤、カプセル剤、チュアブル錠、液剤等の剤型を工夫することによって利用しやすくすることができる。

【0034】

また、本発明の製剤には、必要に応じて、適宜所望の添加剤を配合することもできる。

【0035】

食品

本発明の経口用育毛剤は、育毛用食品等のいわゆる明らかな食品の形態として適用することができる。

【0036】

本発明の経口用育毛剤を用いた育毛用食品等の食品は、上述した経口用育毛剤をそのまま加工して利用するか、もしくは食品を調製するために使用することのできる任意の素材と混合し、粉末状、塊状、液状などの各種形態に加工すること

により、調製される。

【0037】

また、塊状、液状、シロップ状、粉末状、ゼリー状などの各種形態の食品に、常法に従って配合して調製してもよい。

【0038】

かかる形態の具体例としては、清涼飲料水、ジュース、茶類などの飲料（ドリンク剤）、粉末ジュース、粉末スープなどの粉末飲料、クッキー、ビスケット、シリアル、チューインガム、キャンディー、グミ、タブレット、ウェハース、せんべいなどの菓子類などが挙げられる。

【0039】

また、本発明においては、本発明の効果を損なわない範囲で、通常食品に用いられる他の成分、例えば、他の薬効成分、栄養素、動植物成分、賦形剤、増量剤、甘味料、香味剤、着色剤、防腐剤、乳化剤、可溶化剤、多価アルコールおよびそのエステル誘導体、有機および無機酸およびその塩類、水溶性高分子なども配合することができる。

【0040】

【実施例】

次に実験例及び実施例を挙げて本発明をさらに詳しく説明するが、本発明はこれらに限定されることはない。

【0041】

実験例

（i）抽出物の調製

ネコノヒゲ、ミツバハマゴウ及びセイヨウニンジンボクそれぞれについて、全草乾燥物100gを細切し、2000mlのエタノールを加え、70℃に加温しながら2時間抽出した。ろ過後、残渣に再び2000mlのエタノールを加え、さらに2時間抽出後、2回の抽出で得られたろ液を集め、減圧濃縮の後、凍結乾燥して、抽出物を得た。

【0042】

（ii）外用および内服投与による発毛促進試験とその評価

C3H/He 雄性マウス 8 週齢の背部を約 2×4 cm の大きさに刈毛後、翌日より外用の場合は、(i) で得た抽出物を 1 重量% 含む 50% エタノール水溶液を、1 日 1 回、10 日間、刈毛部に 0.1 ml ずつ塗布した。内服の場合は (i) で得た抽出物を 5 重量% 含む 0.5% カルボキシメチルセルロース水溶液を体重 1 kg 当たり 1 g となる投与量で 1 日 1 回、10 日間、経口投与した。発毛効果は刈毛部位の毛の再生を比較することにより検討した。

【0043】

発毛促進の効果は、対照群（外用の場合は 50% エタノール塗布群、内服の場合は 0.5% カルボキシメチルセルロース投与群）の毛再生率を 100% とした場合の相対的割合で表し、その増加分を発毛促進率として表した。ネコノヒゲ抽出物の試験結果を表 1 に示す。

【0044】

【表 1】

	検体	毛再生相対値 (%)	発毛促進率 (%)
外用	対照群	100	
	ネコノヒゲ抽出物	121	21
内服	対照群	100	
	ネコノヒゲ抽出物	185	85

【0045】

表 1 の結果に示されるように、ネコノヒゲ抽出物は外用で適用した場合よりも内服で摂取した方が優れた発毛促進効果を有することが明らかになった。またミツバハマゴウ抽出物およびセイヨウニンジンボク抽出物についても同様の効果が認められた。

【0046】

実施例 1：糖衣錠の調製

実験例で調製した抽出物について、下記の処方により各成分を混合して、常法に従って糖衣錠を調製した。

【0047】

例 1-A

成分	配合量 (%)
ドロマイト	残部
(カルシウム 20%、マグネシウム 10%含有)	
粉末還元麦芽糖水飴	20
乳糖	17
蔗糖脂肪酸エステル	3
ネコノヒゲ抽出物	5

【0048】

例 1-B

成分	配合量 (%)
ドロマイト	残部
(カルシウム 20%、マグネシウム 10%含有)	
粉末還元麦芽糖水飴	20
乳糖	17
蔗糖脂肪酸エステル	3
セイヨウニンジンボク抽出物	5

【0049】

例 1-C

成分	配合量 (%)
ドロマイト	残部
(カルシウム 20%、マグネシウム 10%含有)	
粉末還元麦芽糖水飴	20
乳糖	17
蔗糖脂肪酸エステル	3
ミツバハマゴウ抽出物	5

【0050】

実施例 2：タブレットの調製

実験例で調製した抽出物について、下記の処方により各成分を混合して、常法

に従ってタブレットを調製した。

【0051】

例2-A

成分	配合量 (%)
デキストリン	残部
粉末還元麦芽糖水飴	20
乳糖	20
トレハロース	10
ネコノヒゲ抽出物	5
アスパルテーム	微量
香料	微量

【0052】

例2-B

成分	配合量 (%)
デキストリン	残部
粉末還元麦芽糖水飴	20
乳糖	20
トレハロース	10
セイヨウニンジンボク抽出物	5
アスパルテーム	微量
香料	微量

【0053】

例2-C

成分	配合量 (%)
デキストリン	残部
粉末還元麦芽糖水飴	20
乳糖	20
トレハロース	10
ミツバハマゴウ抽出物	5

アスパルテーム

微量

香料

微量

【0054】

実施例3：ドリンク剤の調製

実験例で調製した抽出物について、下記の処方により各成分を混合して、常法に従ってドリンク剤を調製した。

【0055】

例3-A

成分	配合量 (%)
ネコノヒゲ抽出物	5
蔗糖	2
アスコルビン酸	1.5
防腐剤	微量
香料	微量
精製水	残部

【0056】

例3-B

成分	配合量 (%)
セイヨウニンジンボク抽出物	5
蔗糖	2
アスコルビン酸	1.5
防腐剤	微量
香料	微量
精製水	残部

【0057】

例3-C

成分	配合量 (%)
ミツバハマゴウ抽出物	5
蔗糖	2

アスコルビン酸

1.5

防腐剤

微量

香料

微量

精製水

残部

【0058】

【発明の効果】

本発明のシソ科オルソシフォン属又はクマツヅラ科ハマゴウ属に属するいずれかの植物若しくはその植物抽出物を1種又は2種以上含有する経口用育毛剤、並びに該経口用育毛剤を用いた製剤又は食品は、優れた育毛作用を有し、脱毛防止、発毛促進などの効果を有意に発揮する。

【書類名】 要約書

【要約】

【課題】 優れた育毛作用を有し、脱毛防止、発毛促進などの効果を奏する経口用育毛剤又は食品を提供すること。

【解決手段】 シソ科オルソシフォン属又はクマツヅラ科ハマゴウ属に属するいずれかの植物若しくはその植物抽出物を1種または2種以上含有する経口用育毛剤並びに該経口用育毛剤を用いた製剤又は食品。

【選択図】 なし

特願 2 0 0 2 - 2 4 8 5 7 9

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号

[0 0 0 1 0 6 3 2 4]

1. 変更年月日
[変更理由]

1 9 9 0 年 8 月 2 3 日

新規登録

住 所
氏 名

大阪府高槻市朝日町 3 番 1 号
サンスター株式会社

特願 2002-248579

出願人履歴情報

識別番号

[000004156]

1. 変更年月日

1990年 8月13日

[変更理由]

新規登録

住 所

京都府京都市南区吉祥院西ノ庄門口町14番地

氏 名

日本新薬株式会社

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ **BLACK BORDERS**
- ☐ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- ☐ **FADED TEXT OR DRAWING**
- ☐ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- ☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- ☐ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- ☐ **GRAY SCALE DOCUMENTS**
- ☒ **LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- ☐ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- ☐ **OTHER:** _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.